

BEST AVAILABLE COPY

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19)世界知的所有権機関  
国際事務局



(43)国際公開日  
2005年9月15日 (15.09.2005)

PCT

(10)国際公開番号  
WO 2005/085237 A1

(51) 国際特許分類: C07D 405/04, A61K 31/351, 31/381, 31/404, 45/00, A61P 3/04, 3/06, 3/10, 7/10, 9/04, 9/10, 9/12, 19/06, 43/00, C07D 407/04, 409/04

(72) 発明者: および  
(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 伏見信彦 (FUSHIMI,Nobuhiko) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県南安曇郡穂高町大字柏原4365-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 伊佐治正幸 (ISAJI,Masayuki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県南安曇郡穂高町大字柏原4365-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 藤倉秀紀 (FUJIKURA,Hideki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県南安曇郡穂高町大字柏原4365-1 キッセイ薬品工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/004158

(22) 国際出願日: 2005年3月3日 (03.03.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2004-61428 2004年3月4日 (04.03.2004) JP

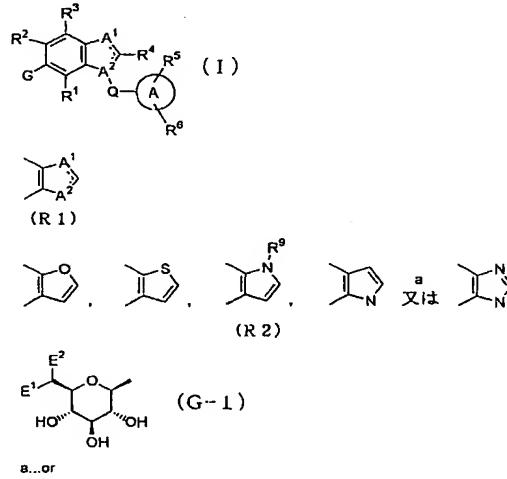
(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): キッセイ薬品工業株式会社 (KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒399-8710 長野県松本市芳野19番48号 Nagano (JP).

(81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,

[続葉有]

(54) Title: FUSED HETEROCYCLE DERIVATIVE, MEDICINAL COMPOSITION CONTAINING THE SAME, AND MEDICINAL USE THEREOF

(54) 発明の名称: 縮合複素環誘導体、それを含有する医薬組成物およびその医薬用途



(57) Abstract: A fused heterocycle derivative represented by the following general formula (I), a pharmacologically acceptable salt thereof, or a prodrug of either [in the formula, R<sup>1</sup> to R<sup>4</sup> each is hydrogen, OH, amino, etc.; R<sup>5</sup> and R<sup>6</sup> each is hydrogen, OH, halogeno, optionally substituted alkyl, etc.; Q is alkylene, alkenylene, etc.; ring A is aryl or heteroaryl; the ring (R1) shown below is any of the rings (R2) shown below; and G is a group represented by the following general formula (G-1) or (G-2) (wherein E<sup>1</sup> is hydrogen, fluorine, or OH; and E<sup>2</sup> is hydrogen, fluorine, methyl, etc.)]. They have human SGLT inhibitory activity and are useful as a preventive or therapeutic agent for diseases attributable to hyperglycemia, such as diabetes, postprandial hyperglycemia, impaired glucose tolerance, complications of diabetes, and obesity.

[続葉有]

WO 2005/085237 A1



SG, SK, SE, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,  
US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,  
MR, NE, SN, TD, TG).

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護  
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,  
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ヨーラシア (AM, AZ,  
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,  
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,  
IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),

添付公開書類:  
— 國際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

本発明は、ヒトSGLT活性阻害作用を発現し、糖尿病、食後高血糖、耐糖能異常、糖尿病性合併症、肥満症等の、高血糖症に起因する疾患の予防又は治療剤として有用な、下記一般式(I)で表される縮合複素環誘導体またはその薬理学的に許容される塩、或いはそれらのプロドラッグ

[式中、R<sup>1</sup>～R<sup>4</sup>はH、OH、アミノ基等；R<sup>5</sup>及びR<sup>6</sup>はH、OH、ハロゲン原子、置換可アルキル基等；Qはアルケレン、アルケニレン等；環Aはアリール基又はヘテロアリール基；下記環(R1)は、下記環(R2)で表される基；Gは下記一般式(G-1)又は(G-2)で表される基

(E<sup>1</sup>はH、F又はOH；E<sup>2</sup>はH、F、メチル基等)]、並びにそれを含有する医薬組成物及びその医薬用途を提供するものである。

